

517, 612

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION  
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

Rec'd PCT/PTO 22 DEC 2004

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
8 janvier 2004 (08.01.2004)

PCT

(10) Numéro de publication internationale  
WO 2004/002984 A2

(51) Classification internationale des brevets<sup>7</sup> :  
C07D 401/12, 401/06, A61K 51/04

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2003/002028

(22) Date de dépôt international : 30 juin 2003 (30.06.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
02/08203 1 juillet 2002 (01.07.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : COM-  
MISSARIAT A L'ENERGIE ATOMIQUE (FR/FR);  
31/33, rue de la Fédération, F-75752 PARIS 15ème (FR).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : DOLLE,  
Frédéric (FR/FR); 10, allée de Villeneuve, F-91940  
GOMETZ-LE-CHATEL (FR).

(74) Mandataire : AUDIER, Philippe; c/o BREVATOME, 3,  
rue du Docteur Lancereaux, F-75008 PARIS (FR).

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,  
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,  
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,  
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,  
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD,  
SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,  
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet  
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet  
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK,  
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,  
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

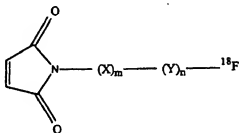
Publiée :

— avec rapport de recherche internationale  
— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des  
revendications, sera republiée si des modifications sont re-  
çues

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: MARKED MALEIMIDE COMPOUNDS, METHOD FOR PREPARING SAME AND USE THEREOF FOR MARK-  
ING MACROMOLECULES

(54) Titre : COMPOSES DE MALEIMIDES MARQUES, LEUR PROCEDE DE PREPARATION ET LEUR UTILISATION  
POUR LE MARQUAGE DE MACROMOLECULES



(57) Abstract: The invention concerns maleimide compounds  
marked with Fluor 18 of general formula (I), wherein: m represents  
an integer from 0 to 10; n represents an integer from 1 to 10; Y  
represents a group selected among optionally substituted heterocyclic,  
monocyclic or bicyclic groups; X represents a radical of formula (U)  
 $a - ((CR_1R_2)_b - (V)_c)_d - ((CR_3R_4)_e - (V)_f)_g$ , wherein: a, b, c, d, e, f,  
g represent each independently an integer from 0 to 10; 0 A 10; U,  
V and W represent each independently -NR<sub>1</sub>-, -O-, -S-, formula (II),  
ethynyl, -CR<sub>1</sub>=CR<sub>2</sub>-, -(C=O)-, -(C=S)-, -C(=O)O-, -(C=S)  
O-, -(C=S)S-, -C(=NR<sub>1</sub>)NR<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>OR<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>-. The invention

also concerns a method for preparing said compounds, their use for marking macromolecules and complexes of said compounds  
with a macromolecule. The invention further concerns a kit for analysis, detection, or diagnosis using said compounds. The  
invention finally concerns the use of the complexes in a medical imaging method such as position emission tomography (PET).

(57) Abrégé : Composés de maléimide marqués par le fluor 18 de formule générale (I) : (FORMULE) dans laquelle : - m représente un  
nombre entier de 0 à 10 ; - n représente un nombre entier de 1 à 10 ; - Y représente un groupe choisi parmi les groupes hétérocycliques  
monocycliques ou bicycliques, éventuellement, substitués ; - X représente un radical de formule : (U)<sub>a</sub> - ((CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>)<sub>b</sub> - (V)<sub>c</sub>)<sub>d</sub> - ((CR<sub>3</sub>R<sub>4</sub>)<sub>e</sub> - (V)<sub>f</sub>)<sub>g</sub>, dans laquelle : a, b, c, d, e, f, g représentent chacun indépendamment un nombre entier de 0 à 10 ; U, V et W représentent  
chacun indépendamment -NR<sub>1</sub>-, -O-, -S-, (FORMULE), éthynyle, -CR<sub>1</sub>=CR<sub>2</sub>-, -(C=O)-, -(C=S)-, -(C=S)-, -C(=O)O-, -(C=S)O-, -(C=S)S-,  
-C(=NR<sub>1</sub>)NR<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>R<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>OR<sub>2</sub>-, -CR<sub>1</sub>NR<sub>2</sub>R<sub>3</sub>-. Procédé de préparation de ces composés ; leur utilisation pour  
le marquage de macromolécules et complexes de ces composés avec une macromolécule. Trousse d'analyse et de détection, ou de  
diagnostic comprenant lesdits complexes. Utilisation des complexes dans un procédé d'imagerie médicale tel que la tomographie par  
émission de positons (TEP).

WO 2004/002984 A2